

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
11 janvier 2001 (11.01.2001)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 01/02380 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷:
C07D 295/06, 295/02, 295/08, A61K 31/55, A61P 25/00

(74) Mandataire: THOURET-LEMAITRE, Elisabeth;
Sanofi-Synthelabo, 174, avenue de France, F-75013 Paris
(FR).

(21) Numéro de la demande internationale:

PCT/FR00/01790

(81) États désignés (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,

(22) Date de dépôt international: 27 juin 2000 (27.06.2000)

BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE,

(25) Langue de dépôt:

français

DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,

(26) Langue de publication:

français

ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,

(30) Données relatives à la priorité:

99/08532 2 juillet 1999 (02.07.1999) FR

LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO,

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US):
SANOFI-SYNTHELABO [FR/FR]; 174, avenue de
France, F-75013 Paris (FR).

NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR,

TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) États désignés (régional): brevet ARIPO (GH, GM, KE,

LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), brevet eurasien

(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen

(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU,

MC, NL, PT, SE), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM,

GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventeurs; et

Publiée:

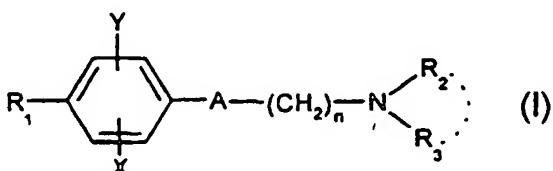
(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement): BOIGE-
GRAIN, Robert [FR/FR]; 80, chemin de Péret, F-34820
Assas (FR). BOURRIE, Martine [FR/FR]; 138, rue
des Kermes, F-34980 Saint-Gely du Fesc (FR). LAIR,
Pierre [FR/FR]; 15, impasse des Chevreuils, F-31120
Goyrans (FR). PAUL, Raymond [FR/FR]; 75, rue des
Chanterelles, F-34980 Saint-Gely du Fesc (FR). PON-
CELET, Martine [FR/FR]; Le Rey, F-34270 Valflaunes
(FR). VERNIERES, Jean-Claude [FR/FR]; Rue Sabatier
Garat, F-31600 Muret (FR).

— Avec rapport de recherche internationale.
— Avant l'expiration du délai prévu pour la modification des
revendications, sera republiée si des modifications sont
reçues.

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: ANTIPSYCHOTIC CYCLIC N-ARALKYL AMINES

(54) Titre: N-ARALKYL AMINES CYCLIQUES ANTIPSYCHIOTIQUES



(57) Abstract: The invention concerns antipsychotic compounds of formula (I) wherein: A represents a group selected among the following: -C≡C-; -CH=CH-; -CH₂-CH₂-; n is equal to 1 or 2; X represents a hydrogen, chlorine or fluorine atom, a methyl or methoxy group; Y represents a hydrogen atom or a chlorine or a fluorine atom; R₁ represents a cyclohexyl, phenyl, cycloheptyl, tertiary butyl, dicyclopentylmethyl, bicyclo[3.2.1]octanyl, 4-tetrahydropyranyl, 4-tetrahydrothiopyranyl or

adamantyle group; R₂ and R₃ form together with the nitrogen atom whereto they are bound a cyclic amine; and the additive salts of said compounds with pharmaceutically acceptable acids, as well as their solvates and hydrates.

(57) Abrégé: Composés antipsychotiques de formule (I) dans laquelle: A représente un groupe choisi parmi les suivants: -C≡C-; -CH=CH-; -CH₂-CH₂-; n est égal à 1 ou 2; X représente un atome d'hydrogène, de chlore ou de fluor ou un groupe méthyle ou méthoxy; Y représente un atome d'hydrogène ou un atome de chlore ou de fluor; R₁ représente un groupe cyclohexyle phényle cycloheptyle, tert-butyle, dicyclopentylméthyle, bicyclo[3.2.1]octanyle, 4-tetrahydropyranyle, 4-tetrahydrothiopyranyle ou adamantyle; R₂ et R₃ forment avec l'atome d'azote auquel ils sont liés une amine cyclique et les sels d'addition de ces composés avec des acides pharmaceutiquement acceptables, ainsi que leurs solvats et hydrates.

A1

80

WO 01/02380